

16C1  
Translation  
09/551402

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

2753

RECEIVED  
DEC 04

TECH/CEN

Applicant's or agent's file reference <b>FJ-89PCT</b>	<b>FOR FURTHER ACTION</b>	See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)
International application No. <b>PCT/JP98/05620</b>	International filing date ( <i>day/month/year</i> ) <b>11 December 1998 (11.12.98)</b>	Priority date ( <i>day/month/year</i> ) <b>12 December 1997 (12.12.97)</b>
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC <b>C07C 259/06, 237/22, 213/74, C07D 233/74, 295/18, C07F 9/38, C07H 13/04, A61K 31/215, 31/275, 31/27, 31/16, 31/18, 31/24, 31/70, 31/445, 31/535, 31/44, 31/415</b>		
Applicant <b>FUJI YAKUHIN KOGYO KABUSHIKI KAISHA</b>		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.
2. This REPORT consists of a total of 5 sheets, including this cover sheet.

This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).

These annexes consist of a total of \_\_\_\_\_ sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:

- I  Basis of the report
- II  Priority
- III  Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- IV  Lack of unity of invention
- V  Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- VI  Certain documents cited
- VII  Certain defects in the international application
- VIII  Certain observations on the international application

Technology Center 2600  
NOV 2 9 2000  
RECEIVED

Date of submission of the demand <b>10 March 1999 (10.03.99)</b>	Date of completion of this report <b>07 October 1999 (07.10.1999)</b>
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP98/05620

**I. Basis of the report****1. With regard to the elements of the international application:\*** the international application as originally filed the description:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed

pages \_\_\_\_\_, filed with the demand

pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_

 the claims:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed

pages \_\_\_\_\_, as amended (together with any statement under Article 19)

pages \_\_\_\_\_, filed with the demand

pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_

 the drawings:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed

pages \_\_\_\_\_, filed with the demand

pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_

 the sequence listing part of the description:

pages \_\_\_\_\_, as originally filed

pages \_\_\_\_\_, filed with the demand

pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_

**2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.**

These elements were available or furnished to this Authority in the following language \_\_\_\_\_ which is:

 the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)). the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)). the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).**3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:** contained in the international application in written form. filed together with the international application in computer readable form. furnished subsequently to this Authority in written form. furnished subsequently to this Authority in computer readable form. The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished. The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.**4.  The amendments have resulted in the cancellation of:** the description, pages \_\_\_\_\_ the claims, Nos. \_\_\_\_\_ the drawings, sheets/fig. \_\_\_\_\_**5.  This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).\*\***

\* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

\*\* Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

# INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP98/05620

## III. Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

1. The questions whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step (to be non obvious), or to be industrially applicable have not been examined in respect of:

the entire international application.  
 claims Nos. \_\_\_\_\_ 8 \_\_\_\_\_

because:

the said international application, or the said claims Nos. \_\_\_\_\_ 8 \_\_\_\_\_ relate to the following subject matter which does not require an international preliminary examination (*specify*):

See supplemental sheet for continuation of Box III.1

the description, claims or drawings (*indicate particular elements below*) or said claims Nos. \_\_\_\_\_ are so unclear that no meaningful opinion could be formed (*specify*):

the claims, or said claims Nos. \_\_\_\_\_ are so inadequately supported by the description that no meaningful opinion could be formed.  
 no international search report has been established for said claims Nos. \_\_\_\_\_ 8 \_\_\_\_\_.

2. A meaningful international preliminary examination cannot be carried out due to the failure of the nucleotide and/or amino acid sequence listing to comply with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions:

the written form has not been furnished or does not comply with the standard.  
 the computer readable form has not been furnished or does not comply with the standard.

**INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT**

International application No.

PCT/JP 98/05620

**Supplemental Box**

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: III. 1

Claim 8 pertains to methods for treatment of the human body by therapy, and thus relates to a subject matter which does not require international preliminary examination by this International Preliminary Examining Authority, under the provisions of PCT Article 34 (4) (a) (i) and PCT Rule 67.1 (iv).

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP 98/05620

## V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

## 1. Statement

Novelty (N)	Claims	1-7, 9-12	YES
	Claims	13-15	NO
Inventive step (IS)	Claims	1-7, 9-12	YES
	Claims	13-15	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-7, 9-12	YES
	Claims	13-15	NO

## 2. Citations and explanations

Claim 13 is disclosed in Document 1 cited in the international search report (JP, 56-158746, A (The Wellcome Foundation Ltd.), December 7, 1981 (07.12.81) & EP, 38046, A2), claims, and therefore is not novel and does not involve an inventive step.

Claim 14 is disclosed in Document 2 cited in the international search report (JP, 4-352757, A (H. Hoffmann-La Roche AG), December 7, 1992 (07.12.92) & EP, 497192, A2 & US, 5304549, A), page 8, and therefore is not novel and does not involve an inventive step.

Claim 15 is disclosed in Document 3 cited in the international search report (JP, 57-116043, A (Tetsuo Suami), July 19, 1982 (19.07.82) & US, 4452814, A), claims, and therefore is not novel and does not involve an inventive step.

09/581402

416 Rec'd PCT/PTO 12 JUN 2000

IN THE UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE

IN RE INTERNATIONAL  
APPLICATION OF: Tetsunori FUJISAWA et al.

INTERNATIONAL SERIAL NO: PCT/JP98/05620

INTERNATIONAL FILING DATE: 11.12.98

FOR: NOVEL METALLOPROTEINASE INHIBITORS

Verification of Translation

Honorable Commissioner of Patents & Trademarks  
Washington, D.C. 20231

Sir:

Akinobu MIZUNO, a translator of Lions Mansion

Shibuya Dogenzaka 303, 22-12, Maruyama-cho, Shibuya-ku,  
Tokyo 150-0044 Japan

declares:

- 1) that he knows well both the Japanese and English languages;
- 2) that he translated the above-identified International Application from Japanese to English;
- 3) that the attached English translation is a true and correct translation of the above-identified International Application to the best of his knowledge and belief; and
- 4) that all statements made of his own knowledge are true and that all statements made on information and belief are believed to be true, and further that these statements are made with the knowledge that willful false statements and the like are punishable by fine or imprisonment, or both, under Section 1001 of Title 18 of the United States Code and that such false statements may jeopardize the validity of the application or any patent issuing thereon.

Date: June 1, 2000

By:

  
AKINOBU MIZUNO

## PATENT COOPERATION TREATY

PCT

NOTIFICATION OF THE RECORDING  
OF A CHANGE(PCT Rule 92bis.1 and  
Administrative Instructions, Section 422)

Date of mailing (day/month/year)

15 December 1999 (15.12.99)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

MIZUNO, Akinobu  
 Gloria Miyamasuzaka III 305  
 10-7, Shibuya 1-chome  
 Shibuya-ku  
 Tokyo 150-0002  
 JAPON

Applicant's or agent's file reference

FJ-89PCT

## IMPORTANT NOTIFICATION

International application No.

PCT/JP98/05620

International filing date (day/month/year)

11 December 1998 (11.12.98)

1. The following indications appeared on record concerning:

the applicant     the inventor     the agent     the common representative

Name and Address

MIZUNO, Akinobu  
 Gloria Miyamasuzaka III 305  
 10-7, Shibuya 1-chome  
 Shibuya-ku  
 Tokyo 150-0002  
 Japan

State of Nationality

State of Residence

Telephone No.

03 3406 0953

Facsimile No.

03 3406 0959

Teleprinter No.

2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning:

the person     the name     the address     the nationality     the residence

Name and Address

MIZUNO, Akinobu  
 Lions Mansion Shibuya Dogenzaka 303  
 22-12, Maruyama-cho  
 Shibuya-ku  
 Tokyo 150-0044  
 Japan

State of Nationality

State of Residence

Telephone No.

03 5456 0480

Facsimile No.

03 5456 5090

Teleprinter No.

3. Further observations, if necessary:

4. A copy of this notification has been sent to:

<input checked="" type="checkbox"/> the receiving Office	<input type="checkbox"/> the designated Offices concerned
<input type="checkbox"/> the International Searching Authority	<input checked="" type="checkbox"/> the elected Offices concerned
<input checked="" type="checkbox"/> the International Preliminary Examining Authority	<input type="checkbox"/> other:

The International Bureau of WIPO  
 34, chemin des Colombettes  
 1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Shinji IGARASHI

Facsimile No.: (41-22) 740.14.35

Telephone No.: (41-22) 338.83.38

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

NOTIFICATION OF ELECTION  
(PCT Rule 61.2)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

United States Patent and Trademark  
Office  
(Box PCT)  
Crystal Plaza 2  
Washington, DC 20231  
ÉTATS-UNIS D'AMÉRIQUE

in its capacity as elected Office

Date of mailing:  24 June 1999 (24.06.99)	
International application No.:  PCT/JP98/05620	Applicant's or agent's file reference:  FJ-89PCT
International filing date:  11 December 1998 (11.12.98)	Priority date:  12 December 1997 (12.12.97)
Applicant:  FUJISAWA, Tetsunori et al	

1. The designated Office is hereby notified of its election made:

in the demand filed with the International preliminary Examining Authority on:

10 March 1999 (10.03.99)

in a notice effecting later election filed with the International Bureau on:

\_\_\_\_\_

2. The election  was

was not

made before the expiration of 19 months from the priority date or, where Rule 32 applies, within the time limit under Rule 32.2(b).

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland  Facsimile No.: (41-22) 740.14.35	Authorized officer:  J. Zahra Telephone No.: (41-22) 338.83.38
---	---

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP98/05620

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**

Int.Cl<sup>6</sup> C07C259/06, C07C237/22, C07C213/74, C07D233/74, C07D295/18,  
C07F9/38, C07H13/04, A61K31/215, A61K31/275, A61K31/27,

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl<sup>6</sup> C07C259/06, C07C237/22, C07C213/74, C07D233/74, C07D295/18,  
C07F9/38, C07H13/04, A61K31/215, A61K31/275, A61K31/27,

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP, 4-352757, A (F.Hoffmann-La Roche AG.),	1-7, 9-12
Y	7 December, 1992 (07. 12. 92) & EP, 497192, A2 & US, 5304549, A	14
X	JP, 57-116043, A (Tetsuo Suami), 19 July, 1982 (19. 07. 82) & US, 4452814, A	15
X	JP, 56-158746, A (The Wellcome Foundation Ltd.),	13
Y	7 December, 1981 (07. 12. 81) & EP, 38046, A2	14

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

\* Special categories of cited documents:

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
9 March, 1999 (09. 03. 99)

Date of mailing of the international search report  
16 March, 1999 (16. 03. 99)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP98/05620

## Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1.  Claims Nos.: 8

because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

It pertains to methods for treatment of the human body by therapy and thus relates to a subject matter which this International Searching Authority is not required, under the provisions of Article 17(2)(a)(i) of the PCT and Rule 39.1(iv) of the Regulations under the PCT, to search.

2.  Claims Nos.:

because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3.  Claims Nos.:

because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

## Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1.  As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2.  As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3.  As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4.  No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest  The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.

No protest accompanied the payment of additional search fees.

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

PCT/JP98/05620

**A. (Continuation) CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**

**A61K31/16, A61K31/18, A61K31/24, A61K31/70, A61K31/445, A61K31/535,  
A61K31/44, A61K31/415**

**B. (Continuation) FIELDS SEARCHED**

**A61K31/16, A61K31/18, A61K31/24, A61K31/70, A61K31/445, A61K31/535,  
A61K31/44, A61K31/415**

## 特許協力条約

PCT

## 国際予備審査報告

REC'D 22 OCT 1999  
WIPO PCT

(法第12条、法施行規則第56条)  
(PCT36条及びPCT規則70)

出願人又は代理人 の書類記号 F J - 8 9 P C T	今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知（様式PCT/IPEA/416）を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP98/05620	国際出願日 (日.月.年) 11.12.98	優先日 (日.月.年) 12.12.97
国際特許分類 (IPC) Int.Cl. C07C259/06, C07C237/22, C07C213/74, C07D233/74, C07D295/18, C07F9/38, C07H13/04, A61K31/215, A61K31/275, A61K31/27, A61K31/16, A61K31/18, A61K31/24, A61K31/70, A61K31/445,		
出願人（氏名又は名称） 富士薬品工業株式会社		

1. 国際予備審査機関が作成したこの国際予備審査報告を法施行規則第57条（PCT36条）の規定に従い送付する。

2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 5 ページからなる。

この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関に対して訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面も添付されている。  
(PCT規則70.16及びPCT実施細則第607号参照)  
この附属書類は、全部で        ページである。

3. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

- I  国際予備審査報告の基礎
- II  優先権
- III  新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
- IV  発明の単一性の欠如
- V  PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- VI  ある種の引用文献
- VII  国際出願の不備
- VIII  国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 10.03.99	国際予備審査報告を作成した日 07.10.99
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号 100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官（権限のある職員） 本堂 裕司 電話番号 03-3581-1101 内線 3443
	4H 9049

## I. 国際予備審査報告の基礎

1. この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。PCT規則70.16, 70.17)

出願時の国際出願書類

<input type="checkbox"/>	明細書・ 第 _____	ページ、	出願時に提出されたもの
<input type="checkbox"/>	明細書 第 _____	ページ、	国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
<input type="checkbox"/>	明細書 第 _____	ページ、	付の書簡と共に提出されたもの
<input type="checkbox"/>	請求の範囲 第 _____	項、	出願時に提出されたもの
<input type="checkbox"/>	請求の範囲 第 _____	項、	PCT19条の規定に基づき補正されたもの
<input type="checkbox"/>	請求の範囲 第 _____	項、	国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
<input type="checkbox"/>	請求の範囲 第 _____	項、	付の書簡と共に提出されたもの
<input type="checkbox"/>	図面 第 _____	ページ/図、	出願時に提出されたもの
<input type="checkbox"/>	図面 第 _____	ページ/図、	国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
<input type="checkbox"/>	図面 第 _____	ページ/図、	付の書簡と共に提出されたもの
<input type="checkbox"/>	明細書の配列表の部分 第 _____	ページ、	出願時に提出されたもの
<input type="checkbox"/>	明細書の配列表の部分 第 _____	ページ、	国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
<input type="checkbox"/>	明細書の配列表の部分 第 _____	ページ、	付の書簡と共に提出されたもの

2. 上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である \_\_\_\_\_ 語である。

国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)にいう翻訳文の言語  
 PCT規則48.3(b)にいう国際公開の言語  
 国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語

3. この国際出願は、スクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。

この国際出願に含まれる書面による配列表  
 この国際出願と共に提出されたフレキシブルディスクによる配列表  
 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された書面による配列表  
 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出されたフレキシブルディスクによる配列表  
 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった  
 書面による配列表に記載した配列とフレキシブルディスクによる配列表に記録した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4. 補正により、下記の書類が削除された。

明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
 図面 図面の第 \_\_\_\_\_ ページ/図

5.  この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c) この補正を含む差し替え用紙は上記1.における判断の際に考慮しなければならず、本報告に添付する。)

## III. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

国際出願全体

請求の範囲 \_\_\_\_\_ 8 \_\_\_\_\_

理由 :

この国際出願又は請求の範囲 8 は、国際予備審査をすることを要しない  
次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

治療による人体の処置方法に関するものであり、PCT34条(4)(a)(i)及びPCT規則67.1(iv)の規定により、この国際予備審査機関が国際予備審査をすることを要しない対象に係るものである。

明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 \_\_\_\_\_ の  
記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

全部の請求の範囲又は請求の範囲 \_\_\_\_\_ が、明細書による十分な  
裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

請求の範囲 \_\_\_\_\_ 8 \_\_\_\_\_ について、国際調査報告が作成されていない。

2. ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を満たしていないので、有効な国際予備審査をすることができない。

書面による配列表が提出されていない又は所定の基準を満たしていない。

フレキシブルディスクによる配列表が提出されていない又は所定の基準を満たしていない。

V. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条（PCT35条(2)）に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)

請求の範囲	1 ~ 7, 9 ~ 12	有
請求の範囲	13 ~ 15	無

進歩性 (I S)

請求の範囲	1 ~ 7, 9 ~ 12	有
請求の範囲	13 ~ 15	無

産業上の利用可能性 (I A)

請求の範囲	1 ~ 7, 9 ~ 12	有
請求の範囲	13 ~ 15	無

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

請求の範囲13は、国際調査報告で引用された文献1 (JP, 56-158746, A (ザ・ウェルカム・ファウンデーション・リミテッド) 7.12月. 1981(07.12.81) &EP, 38046, A2) の特許請求の範囲に記載されているので、新規性及び進歩性を有さない。

請求の範囲14は、国際調査報告で引用された文献2 (JP, 4-352757, A (エフ・ホフマンーラ ロシュ アーゲー) 7.12月. 1992(07.12.92) &EP, 497192, A2 &US, 5304549, A) の第8頁に記載されているので、新規性及び進歩性を有さない。

請求の範囲15は、国際調査報告で引用された文献3 (JP, 57-116043, A (須綱哲夫) 19.7月. 1982(19.07.82) &US, 4452814, A) の特許請求の範囲に記載されているので、新規性及び進歩性を有さない。

補充欄（いずれかの欄の大きさが足りない場合に使用すること）

第 欄の続き

国際特許分類（IPC）の続き

A61K31/535, A61K31/44, A61K31/415

## 特許協力条約

PCT



国際調査報告

(法8条、法施行規則第40、41条)  
[PCT18条、PCT規則43、44]

出願人又は代理人 の書類記号 F J - 8 9 P C T	今後の手続きについては、国際調査報告の送付通知様式(PCT/ISA/220)及び下記5を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP98/05620	国際出願日 (日.月.年) 11. 12. 98	優先日 (日.月.年) 12. 12. 97
出願人(氏名又は名称) 富士薬品工業株式会社		

国際調査機関が作成したこの国際調査報告を法施行規則第41条(PCT18条)の規定に従い出願人に送付する。  
この写しは国際事務局にも送付される。

この国際調査報告は、全部で 4 ページである。

この調査報告に引用された先行技術文献の写しも添付されている。

## 1. 国際調査報告の基礎

a. 言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願がされたものに基づき国際調査を行った。  
 この国際調査機関に提出された国際出願の翻訳文に基づき国際調査を行った。

b. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際調査を行った。  
 この国際出願に含まれる書面による配列表

この国際出願と共に提出されたフレキシブルディスクによる配列表

出願後に、この国際調査機関に提出された書面による配列表

出願後に、この国際調査機関に提出されたフレキシブルディスクによる配列表

出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった。

書面による配列表に記載した配列とフレキシブルディスクによる配列表に記録した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

2.  請求の範囲の一部の調査ができない(第I欄参照)。

3.  発明の単一性が欠如している(第II欄参照)。

4. 発明の名称は  出願人が提出したものと承認する。

次に示すように国際調査機関が作成した。

5. 要約は  出願人が提出したものと承認する。

第III欄に示されているように、法施行規則第47条(PCT規則38.2(b))の規定により国際調査機関が作成した。出願人は、この国際調査報告の発送の日から1カ月以内にこの国際調査機関に意見を提出することができる。

6. 要約書とともに公表される図は、  
第 \_\_\_\_\_ 図とする。  出願人が示したとおりである。

なし

出願人は図を示さなかった。

本図は発明の特徴を一層よく表している。

## 第Ⅰ欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見（第1ページの2の続き）

法第8条第3項（PCT17条(2)(a)）の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1.  請求の範囲 8 は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。つまり、

治療による人体の処置方法に関するものであり、PCT17条(2)(a)(i)及びPCT規則39.1(iv)の規定により、この国際調査機関が国際調査をすることを要しない対象に係るものである。

2.  請求の範囲 は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、

3.  請求の範囲 は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

## 第Ⅱ欄 発明の単一性が欠如しているときの意見（第1ページの3の続き）

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。

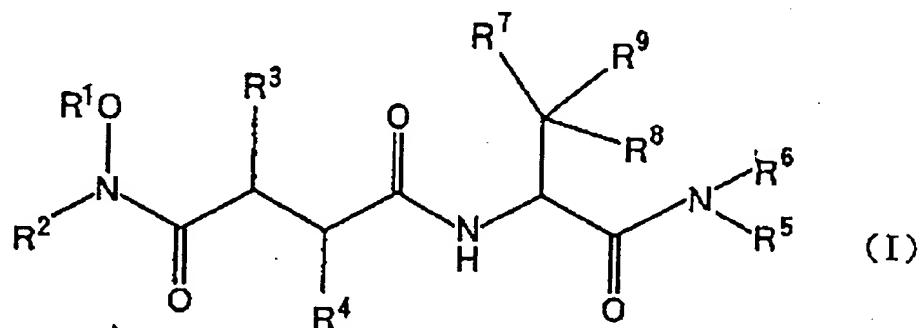
1.  出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2.  追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3.  出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4.  出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

## 追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。
- 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。

## 第Ⅲ欄 要約（第1ページの5の続き）

高いメタロプロテイナーゼ阻害活性を有しているばかりではなく、飛躍的に経口吸収性などの生体での薬物の利用性や生物活性を向上せしめ、医薬として有用な化合物、その製造中間体及びその製造方法を提供する。下記一般式（I）：



[式中、R<sup>1</sup>は水素または水酸基の保護基を表し、R<sup>2</sup>は水素またはアミノ基の保護基を表し、R<sup>3</sup>、R<sup>7</sup>及びR<sup>9</sup>は水素、水酸基、アルキル基等を表し、R<sup>4</sup>はアルキル基、アリールアルキル基等を表し、R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>は、同一又は異なって、水素、アルキル基、シクロアルキル基等を表し、R<sup>8</sup>は水素、水酸基、アミノ基等を表す]で表される化合物、またはその塩は、医薬及び／又は獣医組成物、特にマトリックスマタロプロテイナーゼ類や腫瘍壞死因子- $\alpha$  (TNF- $\alpha$ ) 変換酵素を阻害するメタロプロテイナーゼ阻害剤として有用である。

## A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.° C07C259/06, C07C237/22, C07C213/74, C07D233/74, C07D295/18, C07F9/38, C07H13/04, A61K31/215, A61K31/275, A61K31/27, A61K31/16, A61K31/18, A61K31/24, A61K, 31/70, A61K31/445, A61K31/535, A61K31/44, A61K31/415

## B. 調査を行った分野

## 調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.° C07C259/06, C07C237/22, C07C213/74, C07D233/74, C07D295/18, C07F9/38, C07H13/04, A61K31/215, A61K31/275, A61K31/27, A61K31/16, A61K31/18, A61K31/24, A61K, 31/70, A61K31/445, A61K31/535, A61K31/44, A61K31/415

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

## 国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS(STN), CAOLD(STN), REGISTRY(STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A Y	JP, 4-352757, A (エフ・ホフマンーラ ロシュ アーゲー) 7. 12月. 1992(07. 12. 92) &EP, 497192, A2 &US, 5304549, A	1-7, 9-12 14
X	JP, 57-116043, A (須綱哲夫) 19. 7月. 1982(19. 07. 82) &US, 4452814, A	15
X Y	JP, 56-158746, A (ザ・ウェルカム・ファウンデーション・リミテッド) 7. 12月. 1981(07. 12. 81) &EP, 38046, A2	13 14

 C欄の続きにも文献が列挙されている。 パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&amp;」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

09. 03. 99

国際調査報告の発送日

16.03.99

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

本堂 裕司

印

4 H 9049

電話番号 03-3581-1101 内線 3443